

⑨ 日本国特許庁(JP)

⑩ 特許出願公開

⑫ 公開特許公報(A)

昭63-310813

⑤ Int.Cl.⁴

識別記号

庁内整理番号

④ 公開 昭和63年(1988)12月19日

A 61 K 7/06

7430-4C

審査請求 未請求 発明の数 1 (全12頁)

⑬ 発明の名称 毛髪用組成物

① 特 願 昭62-146497

② 出 願 昭62(1987)6月12日

⑭ 発 明 者 杉 山 圭 吉 神奈川県中郡大磯町石神台1丁目18番13号

⑮ 発 明 者 高 田 康 二 神奈川県藤沢市大鋸909番地2

⑯ 発 明 者 福 島 明 神奈川県藤沢市辻堂東海岸1丁目9-9

⑰ 出 願 人 杉 山 圭 吉 神奈川県中郡大磯町石神台1丁目18番13号

⑱ 代 理 人 弁理士 中 村 稔 外5名

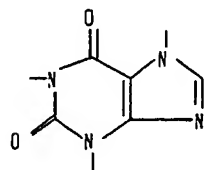
明 細 書

1. 発明の名称 毛髪用組成物

2. 特許請求の範囲

(1)(A) 下記〔I〕式で示される基本骨格を有する

化合物、パバペリン及びその塩、パバペラルジン及びその塩、4-(3-ブトキシ-4-メトキシベンジル)-2-イミダゾリジノン及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1種の化合物と、



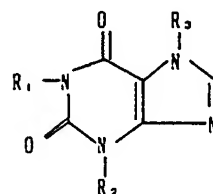
...〔I〕

(B) 奇数の炭素鎖長を有する脂肪酸、アルコール及びそれらの誘導体からなる群から選ばれる少なくとも1種の化合物、

とを含有することを特徴とする毛髪用組成物。

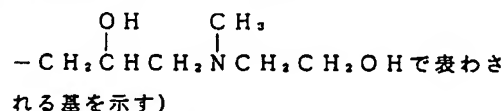
(2) 〔I〕式で示される基本骨格を有する化合物

が、下記一般式〔II〕で表わされるキサンチン系化合物である特許請求の範囲第(1)項記載の毛髪用組成物。



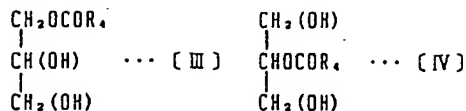
...〔II〕

(式〔II〕中、R₁、R₂、R₃は、水素、炭素数1~8のアルキル基、炭素数1~8のアシル基、-(CH₂)_nCOOHで表わされる基〔但しnは1~7〕又は



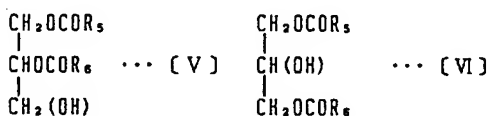
(3) 成分(B)の奇数の炭素鎖長を有する脂肪酸の誘導体が、

4) 下記一般式〔III〕又は〔IV〕で示されるモノグリセライド、



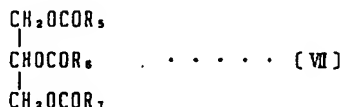
(ただし、 R_s は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

- ロ) 下記一般式〔V〕又は〔VI〕で示されるジグリセライド、



(ただし、 R_s 及び R_s は鎖式有機基であって、これらのうち少なくとも一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

- ハ) 下記一般式〔VII〕で示されるトリグリセライド、



鎖式有機基、 R_s 、 R_{10} は水素又は有機基を表わす)

- ト) 下記一般式〔XI〕で表わされる第2アミド、



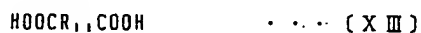
(ただし、 R_s 及び R_s は鎖式有機基であって、これらのうち少なくともいずれか一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 R_s は水素又は有機基を表わす)

- チ) 下記一般式〔XII〕で表わされる第3アミド、



(ただし、 R_s 、 R_s 及び R_s は鎖式有機基であって、これらのうち少なくとも1つは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

- リ) 下記一般式〔XIII〕で表わされる二塩基酸及びその塩、



(ただし、 R_s 、 R_s 及び R_s は鎖式有機基であって、これらのうち少なくとも1つは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

- ニ) 下記一般式〔VIII〕で示される脂肪酸塩、



(ただし、 R_s は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 M は金属原子、 n は M の価数に対応した整数を表わす)

- ホ) 下記一般式〔IX〕で示されるエステル、



(ただし、 R_s は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 R_s は1価若しくは2価アルコール残基、アミン残基、ポリオキシエチレン残基、ソルビタン残基、又はショ糖残基を表わす)

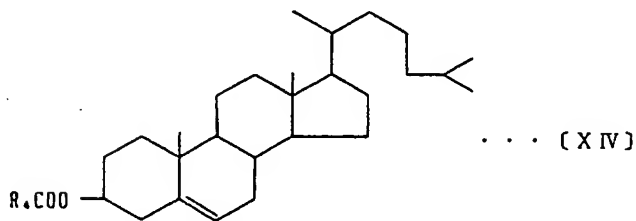
- ヘ) 下記一般式〔X〕で表わされる第1アミド、



(ただし、 R_s は偶数の炭素鎖長を有する直

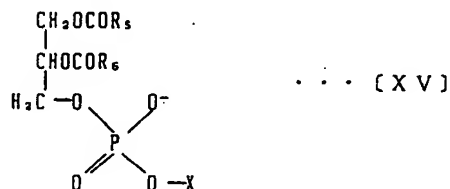
鎖式有機基を表わす)

- ヌ) 下記一般式〔XIV〕で表わされるステロールエステル、



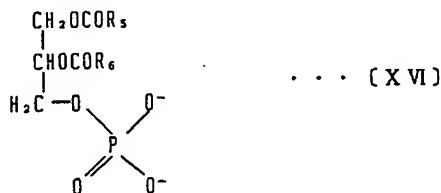
(ただし、 R_s は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

- ル) 下記一般式〔XV〕で示されるリン脂質、



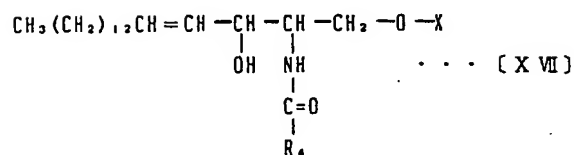
(ただし、 R_5 及び R_6 は鎖式有機基であって、これらのうち少なくともいずれか一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 X はコリン残基、エタノールアミン残基、セリン残基、又はイノシトール残基を表わす)

7) 下記一般式〔XVI〕で示されるフォスファチジン酸、



(ただし、 R_5 及び R_6 は鎖式有機基であって、これらのうち少なくともどちらか一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)、並びに

7) 下記一般式〔XVII〕で示されるスフィンゴ脂質、



(ただし、 R_4 は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 X は糖残基、リン酸残基、又はアミン塩基残基を表わす)

から成る群より選ばれる特許請求の範囲第(1)項記載の毛髪用組成物。

(4) 成分(B)の奇数炭素鎖長を有するアルコール誘導体が、該アルコールのエステル化物又はエーテル化物である特許請求の範囲第(1)項記載の毛髪用組成物。

3. 発明の詳細な説明

〔産業上の利用分野〕

本発明は、頭皮に外用することにより、毛根のメラノサイトを活性化し、メラニン生成を促進して白髪を防止、改善することができる毛髪用組成物、例えばヘアトニック、ヘアクリームなどに関するものである。

〔従来の技術〕

白髪は、加齢に伴う老化現象のひとつであり、美容上の観点から、これを改善する手段として、従来、染毛剤が用いられてきた。しかしながら、使用上の操作の煩わしさ、頭皮に対するかぶれ発生等の点で問題があり、必ずしも使用者の満足が得られるものではなかった。

従って、白髪そのものの発生を本質的に防止ないしは改善する毛髪用製剤の開発が望まれていた。

上記要望に対して、既にいくつかの提案、例えば特開昭60-174705号、同61-165310号、同62-45527号、同62-63509号、同62-63510号があるが、これ

らは有効性、有効成分の安定性、安全性等の点で問題があり、実用上満足すべきものは得られていない。

〔発明が解決しようとする問題点〕

従って、本発明は、頭皮に外用することにより、優れた白髪防止、改善効果を発揮し、皮膚に対する安全性が高い毛髪用組成物を提供することを目的とする。

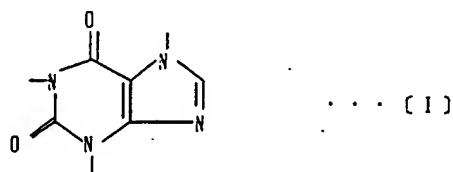
〔問題点を解決するための手段〕

本発明は、生体内で環状ヌクレオチドを特異的に分解する酵素であるホスホジエステラーゼの阻害作用を有する特定の物質と、養毛剤の有効成分として優れた育毛効果を発揮することが知られている奇数の炭素鎖長を有する特定の物質(特開昭59-27809、特開昭60-4113)とを併用すると、著しい白髪防止、改善効果が得られ、上記問題点を有効に解決できるとの新たな知見に基づいてなされたのである。

すなわち、本発明は、

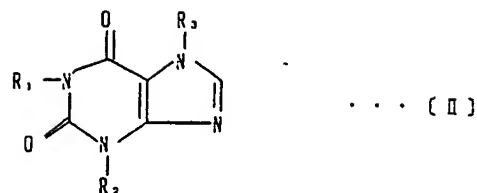
(A) 下記〔I〕式で示される基本骨格を有する化

合物、パバペリン及びその塩、パバペラルジン及びその塩、4-(3-ブトキシ-4-メトキシベンジル)-2-イミダゾリジノン及びその塩からなる群から選ばれる少なくとも1種の化合物と、



(B) 奇数の炭素鎖長を有する脂肪酸、アルコール及びそれらの誘導体からなる群から選ばれる少なくとも1種の化合物、
とを含有することを特徴とする毛髪用組成物を提供する。

本発明では、上記一般式〔I〕で表わされる骨格を分子内に有する限りどのような化合物をも使用することができるが、これらのうち下記一般式〔II〕で表わされる化合物を用いるのが好ましい。



(式〔II〕中、 R_1 、 R_2 、 R_3 は、水素、炭素数1~8、好ましくは1~4のアルキル基、炭素数1~8、好ましくは1~4のアシル基、 $-(CH_2)_nCOOH$ で表わされる基〔但し n は1~7、好ましくは1~3、〕又は、

$$\begin{array}{c} OH \quad CH_3 \\ | \quad | \\ -CH_2-CH-CH_2-N-CH_2-CH_2-OH \end{array}$$

で表わされる基を示す。なお、アルキル基、アシル基にはハロゲン等の置換基があってもよい。また、ナトリウム、カルシウム等の金属と塩を形成させてもよい。さらに、これらの金属塩と、別の塩との間に複合体を形成させてもよい。アミン類と複合体を形成させてもよい。) 上記一般式〔II〕で表わされる化合物には、キ

サンチン(式〔II〕中、 R_1 、 R_2 、 R_3 がいずれも水素の化合物)、その特定の誘導体及びその塩が包含される。

本発明で用いるキサンチン及びその誘導体は、茶葉等の植物体に含まれ、利尿作用、血管拡張作用、強心作用等を有することが知られており、すでに医薬として利用されているものが多い。具体的には、キサンチン、キサンチンナトリウム塩、キサンチノールナイアシン塩、テオフィリン(式〔II〕中、 R_1 、 R_2 がメチル基、 R_3 が水素の化合物)、テオフィリン塩酸塩、テオフィリンカルシウム塩、テオフィリンナトリウム塩、テオフィリンカルシウム塩・サリチル酸カルシウム複合体、テオフィリンナトリウム塩・酢酸ナトリウム複合体、テオフィリンナトリウム・グリシン複合体、テオフィリン・エチレンジアミン複合体、テオフィリン・ジエタノールアミン複合体、テオフィリン・エタノールアミン複合体、テオフィリン・イソプロパノールアミン複合体、7-テオフィリン酢酸、7-テオフィリン酢酸ナトリウム塩、

テオブロミン(式〔II〕中、 R_1 が水素、 R_2 、 R_3 がメチル基の化合物)テオブロミン塩酸塩、テオブロミンサリチル酸塩、テオブロミンナトリウム塩、テオブロミンカルシウム塩、テオブロミンナトリウム塩・酢酸ナトリウム複合体、テオブロミンナトリウム塩・蟻酸ナトリウム複合体、テオブロミンナトリウム塩・サリチル酸ナトリウム複合体、テオブロミンカルシウム・サリチル酸カルシウム複合体、1-テオブロミン酢酸、1-テオブロミン酢酸・ブロムコリン・リン酸複合体、カフェイン(式〔II〕中、 R_1 、 R_2 、 R_3 がメチル基の化合物)、カフェイン塩化金酸塩、カフェイン塩酸塩、カフェインアセタート、カフェイン・安息香酸ナトリウム複合体、カフェイン・クエン酸複合体、3-イソブチル-1-メチルキサンチン等が例示される。

本発明の(A)成分の1つであるパバペリン、パバペラルジンは、アルカロイドの1種であり、鎮静作用、血管拡張作用を有することからすでに医薬として用いられている。又、これらの塩である

パバベリン塩酸塩、パバベリン臭化水素酸塩、パバベリンピクレート、パバベリン亜硝酸塩、パバベラルジン塩酸塩等を用いることもできる。

また、本発明の(A)成分の1つである4-(3-ブトキシ-4-メトキシベンジル)-2-イミダゾリジノンは、現在のところ、ホスホジエステラーゼ阻害剤として生化学試薬に用いられている化合物である。

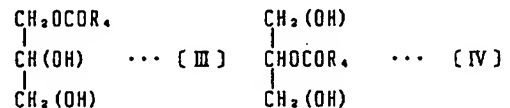
本発明では、必須成分とする前記成分(A)の化合物と、後記成分(B)の化合物とを頭皮に直接施することにより、白髪防止、改善効果を発揮するといふものであり、毛髪用組成物中に成分(A)の化合物を任意の濃度で配合できる。通常は、製品形態、使用頻度にもよるが、各種組成物中に0.001~10重量%(以下、%と略する。)程度、好ましくは0.01~5%配合するのがよい。

成分(B)の化合物として用いる奇数の炭素鎖長を有する脂肪酸及びそれらの誘導体中の脂肪酸は、炭素数を構成している炭素原子の数が奇数のものであれば、飽和脂肪酸であっても不飽和脂肪酸で

あってもかまわない。不飽和脂肪酸は複数の二重結合を含んでいてもよい。また、プロピオン酸(炭素鎖長3)や吉草酸(炭素鎖長5)のような低級脂肪酸でも、ペンタデカン酸(炭素鎖長15)やヘプタデカン酸(炭素鎖長17)のような高級脂肪酸でもよい。このうち、炭素数3~25、より好ましくは9~19のものがよい。

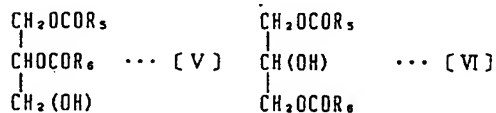
この発明の毛髪用組成物には、このような奇数鎖長の脂肪酸のいずれの誘導体をも用いることができる。ただし、人体に悪影響を及ぼすものを用いることができないことは言うまでもない。好ましい誘導体の例として次のものがあげられる。

イ) 下記一般式〔Ⅲ〕又は〔Ⅳ〕で示されるモノグリセライド、



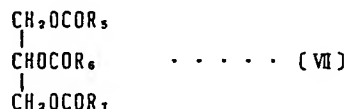
(ただし、 R_1 は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

ロ) 下記一般式〔Ⅴ〕又は〔Ⅵ〕で示されるジグリセライド、



(ただし、 R_1 及び R_2 は鎖式有機基であって、これらのうち少なくとも一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

ハ) 下記一般式〔Ⅶ〕で示されるトリグリセライド、



(ただし、 R_1 、 R_2 及び R_3 は鎖式有機基であって、これらのうち少なくとも1つは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

ニ) 下記一般式〔Ⅷ〕で示される脂肪酸塩、



(ただし、 R_1 は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 M は金属原子、 n は M の価数に対応した整数を表わす)

ホ) 下記一般式〔Ⅸ〕で示されるエステル、



(ただし、 R_1 は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 R_2 は1価若しくは2価アルコール残基、アミン残基、ポリオキシエチレン残基、ソルビタン残基、又はショ糖残基を表わす)

ヘ) 下記一般式〔Ⅹ〕で表わされる第1アミド、



(ただし、 R_1 は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 R_2 、 R_3 は水素又は有機基を表わす)

ト) 下記一般式〔Ⅺ〕で表わされる第2アミド、



(ただし、 R_5 及び R_6 は鎖式有機基であって、これらのうち少なくともいずれか一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 R_7 は水素又は有機基を表わす)

フ) 下記一般式〔X II〕で表わされる第3アミド、



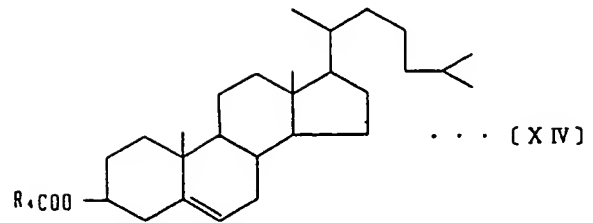
(ただし、 R_5 、 R_6 及び R_7 は鎖式有機基であって、これらのうち少なくとも1つは偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

リ) 下記一般式〔X III〕で表わされる二塩基酸及びその塩、



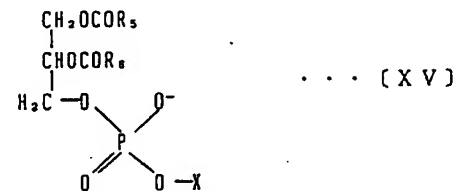
(ただし、 R_{11} は奇数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

ス) 下記一般式〔X IV〕で表わされるステロールエステル、



(ただし、 R_4 は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)

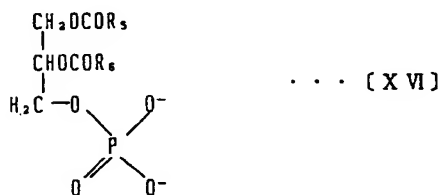
ル) 下記一般式〔X V〕で示されるリン脂質、



(ただし、 R_8 及び R_9 は鎖式有機基であって、これらのうち少なくともいずれか一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 X はコリン残基、エタノールアミン残基、セリン残基、又は

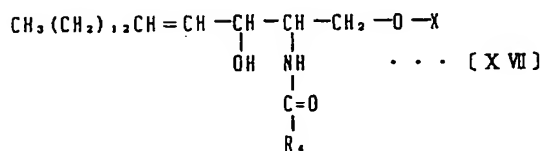
イノシトール残基を表わす)

ヲ) 下記一般式〔X VI〕で示されるフォスファチジン酸、



(ただし、 R_{12} 及び R_{13} は鎖式有機基であって、これらのうち少なくともどちらか一方は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基を表わす)、並びに

チ) 下記一般式〔X VII〕で示されるスフィンゴ脂質、



(ただし、 R_{10} は偶数の炭素鎖長を有する直鎖式有機基、 X は糖残基、リン酸残基、又はアミン塩基残基を表わす)

上記式中、 R_{10} としては炭素数2~24、より好ましくは8~18が望ましい。式〔V〕、〔VI〕、〔X V〕及び〔X VI〕における R_8 及び R_9 は、少なくともどちらか1つが偶数の炭素数、好ましくは2~24、より好ましくは8~18を有するのがよく、最も好ましくは R_8 及び R_9 の両方ともが上記偶数の炭素数を有するのがよい。又、式〔VII〕及び〔X II〕においては、 R_5 、 R_6 のいずれか1つが偶数の炭素数、好ましくは2~24、より好ましくは8~18を有するのがよく、最も好ましくは R_5 、 R_6 のすべてが上記偶数の炭素数を有するのがよい。式〔IX〕中の R_{10} の1価アルコールとしてはメタノール、エタノールなどの炭素数1~18のアルコールがあげられ、アミン残基としてはモノ、ジ、トリエタノールアミンがあげられる。式〔X〕及び〔X I〕中の R_9 、 R_{10} の有機基としてはメチル基、エチル基などの

炭素数1～18のアルキル基が好ましい。

式〔XⅢ〕中の R_{11} としては、メチレン基などの炭素数1～23、より好ましくは1～17の炭化水素基が好ましい。

また、式〔XⅤ〕中、Xがコリン残基のときはフォスファチジルコリン、エタノールアミン残基のときはフォスファチジルエタノールアミン、セリン残基のときはフォスファチジルセリン、イノシトールのときはフォスファチジルイノシトールとなる。

また、式〔VⅢ〕中のMとしては、ナトリウム、カリウム、リチウムなどがあげられる。本発明では(Ⅱ)成分として奇数の炭素鎖長の脂肪酸の他、4)～7)の1種または2種以上の混合物を用いることができる。これらの具体例としては、脂肪酸ではノナン酸、トリデカン酸、ペンタデカン酸、4)としてトリデカン酸モノグリセライド、ペンタデカン酸モノグリセライド、ヘプタデカン酸モノグリセライド、6)としてウンデカン酸ジグリセライド、トリデカン酸ジグリセライド、ペンタデカン酸ジ

グリセライド、8)としてノナン酸トリグリセライド、トリデカン酸トリグリセライド、ペンタデカン酸トリグリセライド、モノペンタデカン酸ジアセチルグリセライド、c)としてノナン酸カリウム塩、ペンタデカン酸ナトリウム塩、6)としてペンタデカン酸エチル、ノナデカン酸メチル、4)としてペンタデカン酸アミド、b)としてN-アセチルペンタデカン酸アミド、f)としてN、N-ジアセチルペンタデカン酸アミド、g)として1，13-トリデカメチレンジカルボン酸、x)としてペンタデカン酸コレステロール、8)として1，2-ジペンタデカノイル-グリセロール-3-フォスホリルコリン、3)として1，2-ジペンタデカノイル-グリセロール-3-リン酸、7)としてN-ペンタデカノイルスフィンゴシン-1-フォスホリルエタノールアミンがあげられる。

本発明の(Ⅱ)成分として使用できる奇数の炭素鎖長を有するアルコール及びそれらの誘導体中のアルコールは、炭素鎖を構成している炭素原子の数が奇数のものであれば、飽和アルコールであって

も不飽和アルコールであってもかまわない。不飽和アルコールは複数の二重結合を含んでいてもよい。また、プロピルアルコール（炭素鎖長3）やアミルアルコール（炭素鎖長5）のような低級アルコールでも、トリコシルアルコール（炭素鎖長23）やペンタコシルアルコール（炭素鎖長25）のような高級アルコールでもよい。さらに、水酸基はどの炭素原子に結合していてもかまわない。これらのうち炭素数3～25、より好ましくは9～19のものを用いるのがよい。

本発明では、さらに成分(Ⅱ)として上記アルコールの誘導体をも用いることができる。代表的な誘導体は奇数鎖長アルコールのエステル化物及びエーテル化物である。

エステル化物は、一般式



で表わされる。この式中、 R_{12} は奇数鎖長アルコール残基、好ましくは炭素数3～25、より好ましくは炭素数9～19の奇数鎖アルコール残基を示す。 R_{13} は脂肪酸残基（好ましくは炭素数2～

24の鎖長を有するもの）：コハク酸、クエン酸、フマル酸、乳酸、ピルビン酸、リンゴ酸、オキサロ酢酸のような有機酸の残基；又は、リン酸等の無機酸の残基を示す。

エーテル化物は、一般式



で表わされるものを包含する。この式中、 R_{12} は奇数鎖長アルコール残基、好ましくは炭素数3～25、より好ましくは9～19の奇数鎖アルコール残基を示す。 R_{14} は1価アルコール残基（好ましくは炭素数2～24の鎖長を有するもの）；グリセリン、ポリグリセリン、エチレングリコール、プロピレングリコール、ブタンジオールのような多価アルコールの残基；又は、ブドウ糖、リボース、ガラクトース、アラビノース、マンノース、キシロース、ソルビトール、マンニトールのような糖の残基を示す。また、エーテル化物は、例えばグリセリンのジ又はトリ奇数鎖長のアルコキシドのように、一分子内に2以上の奇数鎖長アルコール残基を含んでいてもよい。

なお、この発明の毛髪用組成物に用いられる奇数鎖長アルコール誘導体にとって必須的なことは、上述した奇数鎖長アルコールの残基を含むことだけである。従って、例えば上述のエステル化物における酸残基は種々の置換基を有してよい。同様に、上記エーテル化物におけるアルコール残基や糖残基も種々の置換基で置換されていてもよい。もっとも、人体に悪影響を与えるものであってはならないことは言うまでもない。

上記奇数鎖アルコール及びその誘導体として具体的には、ウンデシルアルコール、トリデシルアルコール、ペンタデシルアルコール、ヘプタデシルアルコール、酢酸ノニル、コハク酸ウンデシル、クエン酸ペンタデシル、トリウンデシルグリセリルエーテル、トリペンタデシルグリセリルエーテルの1種又は2種以上の混合物をあげることができる。

本発明の必須成分である、上記成分(B)の化合物は、毛髪用組成物中に任意の濃度で配合できる。通常は、製品形態、使用頻度にもよるが、各種組

成物中に0.01~20重量% (以下、%と略する。)程度、好ましくは0.1~10%配合するのがよい。より好ましくは、成分(A)/(B)を重量比で1/500~50/1となるように配合するのがよい。

本発明の毛髪用組成物には、上記の必須成分に加えて他の薬剤成分として、例えばビタミンA、ビタミンB₆、ビタミンE、パントテン酸、ビオチン等のビタミン類、メチオニン、システイン、シスチン、チロシン等のアミノ酸類、サリチル酸、ヒノキチオール、レゾルシン、トリクロロカルバニリド等の殺菌剤、エチニルエストラジオール、プロゲステロン等のホルモン類等を配合することができ、好ましくは、毛髪用組成物中0.0001~1%添加するのがよい。

さらに、油分、水、界面活性剤、保湿剤、低級アルコール、増粘剤、酸化防止剤、キレート剤、pH調整剤、防腐剤、香料、色素等通常毛髪用製剤に用いられる原料が配合可能である。具体的には、油分としては、オリーブ油、ホホバ油、硬化油等の油脂類、鯨ロウ、蜜ロウ、ラノリン等のロ

ウ類、流動パラフィン、セレシン、スクワラン等の炭化水素類、ステアリン酸、オレイン酸等の脂肪酸類、セタノール、ステアリルアルコール、ラノリンアルコール、ヘキシルデカノール等のアルコール類、ミリスチン酸イソプロピル、ステアリン酸ブチル等のエステル類等である。油分を毛髪用組成物中0.5~85%含有させるのがよい。また、界面活性剤としては、ステアリン酸ナトリウム、セチル硫酸ナトリウム、ポリオキシエチレンラウリルエーテルリン酸、N-アシルグルタミン酸ナトリウム等のアニオン界面活性剤、塩化ステアリルジメチルベンジルアンモニウム、塩化ステアリルトリメチルアンモニウム等のカチオン界面活性剤、塩酸アルキルアミノエチルグリシン液、レシチン等の両性界面活性剤、モノステアリン酸グリセリン、モノステアリン酸ソルビタン、ショ糖脂肪酸エステル、モノステアリン酸プロピレングリコール、ポリオキシエチレンオレイルエーテル、モノステアリン酸ポリエチレングリコール、モメバールミチン酸ポリオキシエチレンソルビタン、

ポリオキシエチレンヤシ脂肪酸モノエタノールアミド、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、ポリオキシエチレンヒマシ油、ポリオキシエチレンラノリン等の非イオン界面活性剤等を例示することができる。界面活性剤を毛髪用組成物中0.1~10%含有させるのがよい。さらに、保湿剤としては、グリセリン、1,3-ブチレングリコール、プロピレングリコール等を、低級アルコールとしては、エタノール、イソプロパノール等を、増粘剤としては、ポリエチレングリコール、カルボキシメチルセルロースナトリウム等を、酸化防止剤としては、ジブチルヒドロキソトルエン、ブチルヒドロキシアニソール、没食子酸プロピル等を、キレート剤としては、エデト酸二ナトリウム、エタンヒドロキシジホスフェート等を、pH調整剤としては、クエン酸、クエン酸ナトリウム、ホウ酸、ホウ砂、リン酸一水素ナトリウム等を、防腐剤としては、パラオキシ安息香酸メチル、パラオキシ安息香酸エチル、デヒドロ酢酸、サリチル酸、安息香酸等をそれぞれ例示す

ることができる。なお、任意成分は、これらに限定されるものではない。上記必須成分と任意成分を適当に配合することにより、ヘアトニック、クリーム、ローション、乳液、軟膏等外用できる剤型のものであればいずれでもよく、種々の製品形態で用いることができる。

具体的には、ヘアトニックとしては、上記必須成分である成分(A)0.01～5%、成分(B)0.1～10%、低級アルコール60～98%、薬剤成分0.0005～1%、保湿剤0.3～1%、精製水0～40%、色素 微量、香料 微量を含有する組成物があげられ、ヘアクリームとしては、上記必須成分である成分(A)0.01～5%、成分(B)0.1～10%、油分30～80%、界面活性剤0.5～5%、保湿剤0.5～5%、精製水 15～70%、酸化防止剤 微量、防腐剤 微量、香料 微量を含有する組成物が例示される。

本発明で用いられる成分(A)と成分(B)とを併用し、これを外用した場合に優れた白髪防止、改善効果を示す作用の詳細は不明であるが頭皮毛根部に存

在するメラノサイト内のホスホジエステラーゼ活性を抑制することにより、メラノサイトを活性化し、メラニン生成を促進するとともに生成したメラニン顆粒の毛母細胞への取り込みを促進することにより、顕著な白髪防止、改善効果が発揮されるものと推定される。

また、本発明の有効成分である成分(A)と成分(B)の併用により皮膚刺激性等の安全性の点で実用上特に問題は認められなかった。

〔発明の効果〕

本発明によれば、頭皮に外用することにより、優れた白髪防止、改善効果を発揮し、皮膚に対する安全性が高い毛髪用組成物が提供される。

従って本発明の毛髪用組成物は、毛髪に適用するための種々の形態、例えば、ヘアトニック、クリーム、ローション、乳液、軟膏、ヘアトリートメント、ヘアコンディショナー等の毛髪化粧料等、外用できる剤型のもので幅広く利用できる。

次に、実施例により本発明を説明する。

実施例1

エタノールに他の成分を順次加えて均一に溶解し、ヘアトニックⅠ～Ⅲを調製した。

表-1に組成を示すが、表中の数値は配合量(重量%)である(以下同じ)。

表-1

| 成分 | 本発明品 | 比較例 | |
|-----------------|------|------|------|
| | | Ⅱ | Ⅲ |
| エタノール | 80.0 | 80.0 | 80.0 |
| オリブ油 | 1.0 | 1.0 | 1.0 |
| α-トコフェロール | 0.5 | 0.5 | 0.5 |
| デオフィリン | 0.3 | 0.3 | — |
| ペンタデカノ酸モノグリセライド | 2.0 | — | — |
| 色素 | 微量 | 微量 | 微量 |
| 香料 | 微量 | 微量 | 微量 |
| 精製水 | 16.2 | 18.2 | 18.5 |

上記ヘアトニックを、白髪のある20名の男女(50～60才)2群を選び、1日2回(朝、夜)、連続3ヵ月間、1群の男女に対してはヘアトニックⅠとⅡを、他の1群の男女に対してはヘアトニックⅡとⅢをハーフ・ヘッド法で左右頭皮に別々に使用させ、塗布部位の状態を、試験前後で比較し、白髪防止、改善効果を調べた。結果を次に示す。

表-2

| Ⅱ (比較例) が よ い | Ⅱ (比較例) が や や よ い | 同 等 | Ⅲ (比較例) が や や よ い | Ⅲ (比較例) が よ い |
|------------------|----------------------|-----|----------------------|------------------|
| 0 | 6 | 14 | 0 | 0 |

表-3

| Ⅰ (本発明) が よ い | Ⅰ (本発明) が や や よ い | 同 等 | Ⅱ (比較例) が や や よ い | Ⅱ (比較例) が よ い |
|------------------|----------------------|-----|----------------------|------------------|
| 1 | 11 | 8 | 0 | 0 |

表-2及び3の結果から、テオフィリン及びベンタデカン酸モノグリセライドを配合した本発明のヘアトニックⅠは、テオフィリンを配合したヘアトニックⅡ及びこれらを添加しないヘアトニックⅢと比較してあきらかに白髪の量を少なくすることができ、顕著な白髪防止・改善効果を示すことがわかる。

なお、上記ヘアトニックの3ヵ月間の使用中及び使用後においても、皮膚の状態に異常な症状は特に認められなかった。

実施例2

表-4に示す成分1～5及び成分6～8を別々に80℃にて加熱溶解した後、両者を混合乳化し、冷却中に成分9を加え、さらに均一分散してヘアクリームⅠ～Ⅲを調製した。

表-4

| 成分 | 本発明品 Ⅰ | 比較例 | |
|----|-----------|------|------|
| | | Ⅱ | Ⅲ |
| 1 | 5.0 | 5.0 | 5.0 |
| 2 | 5.0 | 5.0 | 5.0 |
| 3 | 45.0 | 45.0 | 45.0 |
| 4 | 3.0 | 3.0 | 3.0 |
| 5 | 1.0 | — | — |
| 6 | 0.8 | 0.8 | — |
| 7 | 微量 | 微量 | 微量 |
| 8 | 40.2 | 41.2 | 42.0 |
| 9 | 微量 | 微量 | 微量 |

実施例1と同様にして、ヘアクリーム of 白髪防止、改善効果を調べた。結果を表-5及び6に示す。

表-5

| Ⅱ (比較例) が よ い | Ⅱ (比較例) が や や よ い | 同 等 | Ⅲ (比較例) が や や よ い | Ⅲ (比較例) が よ い |
|------------------|----------------------|-----|----------------------|------------------|
| 0 | 6 | 13 | 1 | 0 |

表-6

| Ⅰ (本発明) が よ い | Ⅰ (本発明) が や や よ い | 同 等 | Ⅱ (比較例) が や や よ い | Ⅱ (比較例) が よ い |
|------------------|----------------------|-----|----------------------|------------------|
| 1 | 10 | 9 | 0 | 0 |

表-5及び6の結果から、パバベリン塩酸塩及びトリデカン酸ジグリセライドを配合した本発明のヘアクリームⅠは、パバベリン塩酸塩を配合したヘアクリームⅡ及びこれらを添加しないヘアクリームⅢと比較して明らかに白髪の量を少なくすることができ、顕著な白髪防止、改善効果を示すことがわかる。

なお、上記ヘアクリームの3ヵ月間の使用中及び使用後においても、皮膚の状態に異常な症状は特に認められなかった。

実施例3

表-7に示す成分1~7及び成分8~11を別々に80℃にて加熱溶解した後、両者を混合乳化し、冷却中に、成分12を加え、さらに均一分散して、毛髪用乳液Ⅰ~Ⅲを調製した。

表-7

| | 成分 | 比較例 | | |
|----|--------------------|------|------|------|
| | | Ⅰ | Ⅱ | Ⅲ |
| 1 | ステアリン酸 | 3.0 | 3.0 | 3.0 |
| 2 | セタノール | 1.0 | 1.0 | 1.0 |
| 3 | ワセリン | 4.0 | 4.0 | 4.0 |
| 4 | 流動パラフィン | 10.0 | 10.0 | 10.0 |
| 5 | モノオレイン酸 | 3.0 | 3.0 | 3.0 |
| 6 | 酢酸ウンデシル | 5.0 | — | — |
| 7 | 3-イソブチル-1-メチルキサンチン | 0.1 | 0.1 | 3.0 |
| 8 | ポリエチレングリコール1500 | 3.0 | 3.0 | 3.0 |
| 9 | トリエタノールアミン | 1.0 | 1.0 | 1.0 |
| 10 | 防腐剤 | 微量 | 微量 | 微量 |
| 11 | 精製水 | 69.9 | 74.9 | 75.0 |
| 12 | 香料 | 微量 | 微量 | 微量 |

実施例 1 と同様にして乳液の白髪防止、改善効果を調べた。結果を表-11 及び 12 に示す。

表-11

| | | | |
|-------------------------------|----|-------------------------------|---|
| II (比較例) が よ い | 0 | II (比較例) が よ い | 0 |
| II (比較例) が や や い | 5 | II (比較例) が や や い | 1 |
| 同 等 | 14 | 同 等 | 0 |
| III (比較例) が や や い | 1 | III (比較例) が や や い | 0 |
| III (比較例) が よ い | 0 | III (比較例) が よ い | 0 |

表-12

| | | | |
|-----------------------------|----|------------------------------|---|
| I (本発明) が よ い | 0 | II (比較例) が よ い | 0 |
| I (本発明) が や や い | 12 | II (比較例) が や や い | 0 |
| 同 等 | 8 | 同 等 | 0 |
| I (本発明) が や や い | 12 | II (比較例) が や や い | 0 |
| I (本発明) が よ い | 0 | II (比較例) が よ い | 0 |

表-11 及び 12 の結果から、3-イソブチル-1-メチルキサンチン及び酢酸ウンデシルを配合した本発明の乳液 I は、3-イソブチル-1-メチルキサンチンを配合した乳液 II 及びこれらを添加しない乳液 III と比較して明らかに白髪の量を少なくすることができ、顕著な白髪防止、改善効果を示すことがわかる。

なお、上記乳液の 3 ヶ月間の使用中及び使用後においても、皮膚の状態に異常な症状は特に認められなかった。

実施例 4

実施例 1 のテオフィリンを、4-(3-ブトキシ-4-メトキシベンジル)-2-イミダゾリジノンに、ペンタデカン酸モノグリセライドをヘプタデシルアルコールに代えた以外は実施例 1 と同様にして白髪防止、改善効果を調べたところ、実施例 1 とほぼ同じ効果を得た。

実施例 5

実施例 1 で用いたペンタデカン酸モノグリセライドの代りに、ノナン酸、モノペンタデカン酸ジ

アセチルグリセライド、ノナデカン酸ナトリウム塩、ヘプタデカン酸メチル、トリデカン酸アミド、N-アセチルウンデカン酸アミド、N、N-ジアセチルノナン酸アミド、1, 13-トリデカメチレンジカルボン酸、ノナン酸コレステロール、1, 2-ジウンデカノイルグリセロー 3-フォスフォリルコリン、1, 2-ジペンタデカノイルグリセロー 3-リン酸、N-トリデカノイルスフィンゴシン-1-フォスフォリルエタノールアミンまたはトリペンタデシルグリセリルエーテルを用いて実施例 1 と同様のヘアトニックを調製し、性能を調べたところ、実施例 1 とほぼ同等の白髪防止、改善効果が得られた。

実施例 6

実施例 2 で用いたババベリン塩酸塩の代りに、キサンチンナトリウム塩、テオブロミン、カフェインまたはババベラルジンをを用いて実施例 2 と同様のヘアクリームを調製し、性能を調べたところ、実施例 2 とほぼ同等の白髪防止、改善効果が得られた。